

第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、_____ 語による翻訳文を基礎とした。
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査
- ☐ PCT規則12.4にいう国際公開
- ☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____ ページ、出願時に提出されたもの
第 _____ ページ*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ ページ*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____ 項、出願時に提出されたもの
第 _____ 項*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの
第 _____ 項*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ 項*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの
第 _____ ページ/図*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ ページ/図*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表(具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表(具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、
それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲 1-12	有
	請求の範囲	無
進歩性 (I S)	請求の範囲	有
	請求の範囲 1-12	無
産業上の利用可能性 (I A)	請求の範囲 1-12	有
	請求の範囲	無

2. 文献及び説明 (PCT規則 70.7)

文献1: JP 2002-30048 A1(セントラル硝子株式会社)2002.01.29, 特許請求の範囲, 実施例2
文献2: JP 10-182578 A(工業技術院長)1998.07.07, 【0007】-【0011】, 【0014】, 【0055】

(1)請求の範囲1、3に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献1、2より進歩性を有しない。

文献1には、光学活性イミンをパラジウム触媒を用いて、水素雰囲気下で不斉還元することにより、光学活性二級アミンに変換した後、該光学活性アミンを加水素分解して、光学活性 α -メチル-ピス-3, 5-(トリフルオロメチル)ベンジルアミンを製造することが記載されている。

そして、文献2には、文献1に記載の光学活性イミンと、イミンの窒素に結合する置換基部分の構造が類似するイミン化合物、また、文献1に記載の光学活性 α -メチル-ピス-3, 5-(トリフルオロメチル)ベンジルアミンと、不斉炭素原子がアミノ基、アルキル基と結合している点で構造が類似する光学活性1-アルキル置換-2, 2, 2-トリフルオロエチルアミンが記載されている。

ここで、出願人は、答弁書において、文献1に記載の光学活性イミンの3, 5-ピス- CF_3 -フェニル基と文献2に記載のイミン化合物のペルフルオロアルキル基の電子求引性の強さの違いから、文献1に記載の光学活性イミンと文献2に記載のイミン化合物の電子化学的環境は相違すると主張する。

しかしながら、強さは異なるものの、3, 5-ピス- CF_3 -フェニル基とペルフルオロアルキル基は共に、電子求引性基である以上、反応性を大きく変える程、文献1に記載の光学活性イミンと文献2に記載のイミン化合物の間に構造的な相違があるとは認めがたい。したがって、文献2に記載のイミン化合物が、文献1に記載の光学活性イミンと同様の反応性を示すこと、イミン化合物の不斉還元、加水素分解によって光学活性1-アルキル置換-2, 2, 2-トリフルオロエチルアミンを製造できることは、当業者が容易に想到し得たことである。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V.2 欄の続き

(2) 請求の範囲2に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献1、2より進歩性を有しない。
上記(1)参照。

また、文献1には、不斉還元の温度は $-50\sim 150^{\circ}\text{C}$ と記載されているから、当業者であれば、容易に該範囲内で最適な温度を採用できる。

(3) 請求の範囲4に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献1、2より進歩性を有しない。
上記(1)(2)参照。

さらに、文献1には、ケトンと光学活性アミンとを、酸性条件下で脱水縮合して光学活性イミンを製造することが記載されているから、該方法で文献2に記載のイミン化合物を製造することは、当業者が適宜行うことである。

(4) 請求の範囲5～8に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献1、2より進歩性を有しない。
上記(1)～(3)参照。

加えて、文献1には、不斉還元反応の後処理として、再結晶などの精製操作を行うことが記載されているように、再結晶は慣用の精製操作であるから、該操作を選択することに格別の創意を要しない。

(5) 請求の範囲9～12に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献1、2より進歩性を有しない。
上記(1)～(4)で述べたとおり、文献2に記載のイミン化合物を不斉還元して、光学活性二級アミンを合成することは、当業者が容易に想到し得たことである。

また、本願発明の光学活性二級アミンは中間体にすぎず、該アミン自体が特別な活性を有するものではないから、本願発明の効果は進歩性の判断を左右するものではない。